

# 特許協力条約

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第12条、法施行規則第56条）

〔PCT36条及びPCT規則70〕

REC'D 28 NOV 2005

WIPO

PCT

出願人又は代理人 の書類記号 09672	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP2004/014684	国際出願日 (日.月.年) 29.09.2004	優先日 (日.月.年) 30.09.2003
国際特許分類 (IPC) Int.Cl. C07D257/04, A61K31/41, 31/437, 31/4709, 31/5377, 31/541, A61P3/10, 13/12, C07D401/10, 413/10, 417/10, 471/04		
出願人 (氏名又は名称) 三共株式会社		

<p>1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。</p> <p>2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 5 ページからなる。</p> <p>3. この報告には次の附属物件も添付されている。</p> <p>a. <input type="checkbox"/> 附属書類は全部で _____ ページである。</p> <p><input type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）</p> <p><input type="checkbox"/> 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙</p> <p>b. <input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で _____ （電子媒体の種類、数を示す）。 配列表に関する補充欄に示すように、電子形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 （実施細則第802号参照）</p>	
<p>4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第I欄 国際予備審査報告の基礎</p> <p><input type="checkbox"/> 第II欄 優先権</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成</p> <p><input type="checkbox"/> 第IV欄 発明の単一性の欠如</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明</p> <p><input type="checkbox"/> 第VI欄 ある種の引用文献</p> <p><input type="checkbox"/> 第VII欄 国際出願の不備</p> <p><input type="checkbox"/> 第VIII欄 国際出願に対する意見</p>	

国際予備審査の請求書を受理した日 28.10.2004	国際予備審査報告を作成した日 10.11.2005	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 瀬下 浩一	4 P 3542
電話番号 03-3581-1101 内線 3490		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2005年4月)

## 第 I 欄 報告の基礎

1. 言語に関し、この予備審査報告は以下のものを基礎とした。

- ☒ 出願時の言語による国際出願  
☐ 出願時の言語から次の目的のための言語である \_\_\_\_\_ 語に翻訳された、この国際出願の翻訳文
- ☐ 国際調査 (PCT規則12.3(a)及び23.1(b))  
☐ 国際公開 (PCT規則12.4(a))  
☐ 国際予備審査 (PCT規則55.2(a)又は55.3(a))

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 \_\_\_\_\_ ページ、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 \_\_\_\_\_ 項、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表 (具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

- ☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表 (具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

\* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

次に、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

- ☒
- 請求の範囲 20, 21

☒ この国際出願又は請求の範囲 20, 21 は、国際予備審査をすることを要しない  
次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 20, 21 は、治療による人体の処置方法に関するものであって、PCT 34 条 (4) (a) (i) 及び PCT 規則 67. 1 (i v) の規定により、国際予備審査を行うことを要しない対象に係るものである。

- ☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 \_\_\_\_\_ の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

- ☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 \_\_\_\_\_ が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

- ☒ 請求の範囲 20, 21 について、国際調査報告が作成されていない。

- 入手可能な配列表が存在せず、有意義な見解を示すことができなかった。

出願人は所定の期間内に、

- ☐ 実施細則の附属書Cに定める基準を満たす紙形式の配列表を提出しなかったため、国際予備審査機関は、認められた形式及び方法で配列表を入手することができなかった。
- ☐ 実施細則の附属書Cに定める基準を満たす電子形式の配列表を提出しなかったため、国際予備審査機関は、認められた形式及び方法で配列表を入手することができなかった。
- ☐ PCT規則13の3.1(a)又は(b)及び13の3.2に基づく命令に応じた、要求された配列表の遅延提出手数料を支払わなかった。

- ☐ 入手可能な配列表に関連するテーブルが存在しないため、有意義な見解を示すことができなかった。すなわち、出願人が、所定の期間内に、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を満たす電子形式のテーブルを提出しなかったため、国際予備審査機関は、認められた形式及び方法でテーブルを入手することができなかった。

- ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に關連するテーブルが電子形式のみで提出された場合において、当該テーブルが、実施細則の附屬書Cの2に定める技術的な要件を満たしていない。

- 詳細については補充欄を参照すること。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	5, 7-11, 13-19, 22-25	有
	請求の範囲	1-4, 6, 12	無
進歩性 (IS)	請求の範囲	5, 7	有
	請求の範囲	1-4, 6, 8-19, 22-25	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-19, 22-25	有
	請求の範囲		無

## 2. 文献及び説明 (PCT規則 70.7)

文献1: KIM, Moohi Yoo et al., Synthesis, biological properties and structure-activity relationships of 2-oxoquinoline derivatives, new nonpeptide angiotensin II receptor antagonists, Korean Journal of Medicinal Chemistry, 1995, Vol.5, No.1, p.28-37

文献2: 上野道雄, ARBの腎保護と血圧の関連, 日本臨牀, 2002. 10. 01, 第60巻, 第10号, p.1999-2004

文献3: WO 2002/083127 A1(MIYATA Toshio) 2002.10.24

文献4: JP 2002-255813 A (扶桑薬品工業株式会社) 2002.09.11

## &lt;請求の範囲1-4, 6, 12について&gt;

請求の範囲1-4, 6, 12に係る発明は、国際調査報告で引用された文献1に記載されているので、新規性、進歩性を有しない。

文献1には、2-オキソテトラヒドロキノリン誘導体(化合物44, 45)が記載され、さらに当該化合物は、アンジオテンシンII受容体拮抗作用を有し、高血圧症に対して有用であることが記載されている。

そして、化合物44, 45は、本願発明の一般式(I)において、Aが(A1)であり、Bが1H-テトラゾール-5-イル基であり、Xがメチレンであり、YがC6アリーレン(フェニレン)基であり、R<sup>1A</sup>がC3又はC5アルキル基であり、R<sup>2A</sup>が水素であり、R<sup>3A</sup>がエチル基である化合物に相当する。

## &lt;請求の範囲14-16, 18-19, 22, 24-25について&gt;

請求の範囲14-16, 18-19, 22, 24-25に係る発明は、国際調査報告で引用された文献1, 2により進歩性を有しない。

文献2には、アンジオテンシンIIは腎の局所で腎障害の進行に重要な役割を果たしていること、それゆえ、アンジオテンシンII受容体拮抗薬が全身血圧の低下とは別に腎障害の進行を抑制する可能性も期待されることが記載されている。さらに、文献2には、2型糖尿病性腎症の大規模臨床介入試験で、アンジオテンシンII受容体拮抗薬であるロサルタンとイルベサルタンは、ともに血圧変化と独立の腎保護作用を示したことが記載されている。

してみると、文献1に記載されるアンジオテンシンII受容体拮抗薬について腎保護作用と密接に関連することが公知のAGEs産生抑制活性を確認し、糖尿病合併症又は糖尿病性腎症の予防若しくは治療のための医薬組成物に用いるものとして、請求の範囲14-16, 18-19, 22, 24-25に記載される発明とすることは、当業者であれば容易に想到し得たものである。

(補充欄に続く)

## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

## 第 V 欄の続き

<請求の範囲 1-4, 8-19, 22-25 について>

請求の範囲 1-4, 8-19, 22-25 に係る発明は、国際調査報告で引用された文献 3 により進歩性を有しない。

文献 3 には、糖化最終産物 (AGEs) 等の蛋白修飾物の生成を抑制する組成物が記載されている。また、文献 3 には、バルサルタン等のビフェニルテトラゾール基を持つ化合物は、蛋白修飾物抑制効果を示し、前記組成物の有効成分として使用できること、蛋白修飾物生成抑制組成物は、特に腎障害、糖尿病合併症 (腎症等) 等の予防および/または治療に有用であることが記載されている。

本願の請求の範囲 1-4, 8-9, 12-19, 22-25 に係る発明と文献 3 の発明とを対比すると、本願請求の範囲 1-4, 8-9, 12-19, 22-25 に記載される発明では、一般式 (IA3) における窒素原子上の置換基がカルボン酸を持つフェニル基であるのに対し、文献 3 のバルサルタンでは、窒素原子上の置換基がカルボン酸を持つイソブチル基である点でのみ相違する。

上記相違点について検討する。

活性発現のために必要な部分構造を固定し、その他の部分構造を代えた化合物を製造し、その活性を確認してみることは、一般的に行われていることである。

してみると、バルサルタンのビフェニルテトラゾール基を固定し、窒素原子上のカルボン酸を持つイソブチル基を、カルボン酸を持つフェニル基に代えた化合物を製造して、その AGEs 産生抑制活性を確認し、請求の範囲 1-4, 8-9, 12-19, 22-25 に記載される発明とすることは、当業者であれば容易に想到し得たものである。

また、アルキルカルボニル基におけるアルキル基の炭素数を代えてみることも、一般的に行われていることであるから、アルキルカルボニル基におけるアルキル基の炭素数を代えた化合物を製造し、AGEs 産生抑制活性を確認して、請求の範囲 10-11 に記載される発明とすることは、当業者であれば容易に想到し得たものである。

<請求の範囲 5, 7 について>

請求の範囲 5, 7 に係る発明は、国際調査報告に引用されたいずれの文献にも記載されておらず、当業者にとって自明のものでもない。

文献 1-4 には、一般式 (I) で表される化合物において、B が 2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イル基である化合物が記載されておらず、一方、本願発明はそれにより良好な AGEs 産生抑制効果を有しており、糖尿病合併症の治療に有用であるという有利な効果を発揮する。